# This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

# **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

## IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problems Mailbox.



HERRICANO SEEST IN

#### WO9961029A1: SLEEP INDUCING AGENT

View Images (24 pages) | View Cart

Premium Data 1: PDF (=2280 KB) | TIFF (=1800 KB) | Fax | More choices...

Inventor(s):

TANAMI, Tohru, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome,

Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan

KAMEO, Kazuya, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome,

Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan

YAMADA, Kenji . Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome,

Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan

OKUYAMA, Shigeru, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome,

Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan

ONO, Naoya, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku,

Tokyo 170.ndash, Japan

Applicant(s):

SATO, Fumie. 2-1-901, Kugenumahigashi, Fujisawa-shi, Kanagawa 251-0026, Japan

Issued/Filed Dates:

Dec. 2, 1999 / May 25. 1999

Application Number:

WO1999JP0002723

IPC Class:

A61K 031/557; C07C 405/00;

Designated Countries:

AU. CA. CN. JP. KR. US. European patent: AT. BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB,

GR. IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE

Abstract:

A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by (CH2)m. a cis-vinylene group or a phenylene group. Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH2 or S(O)nCH2, R1 is a C3-10 cycloalkyl group, a C3-10 cycloalkyl group substituted with a C1-4 alkyl group, a C4-13 cycloalkylaikyi group, a C5-10 alkyl group, a C5-10 alkenyl group, an C5-10 alkynyl group or a bridged cyclic hydrocarbon group. R2 represents a hydrogen atom, a C1-10 alkyl group or a C3-10 cycloalkyl, m is an integer of 1 to 3, and n is 0, 1 or 2, or a pharmaceutically acceptable salt or hydrate thereof.

[Show "fr" Abstract]

Representative image: ₩e<u>w</u> images :

[Show "fr" image]

at timey. Agent, or

KITAGAWA, Tomizo:

Firm:

Foreign References: none

(No patents reference this one)

Nei Doic

Alternate Searches

Patent Number

Boolean Text

Nominate this invention

Dantillann SEARCH PATENT FOR TEXT

(57)要約

A real Arrest Market

式

. . . .

(武中、Xはハロゲン原子を示し、Yは(CH·)。で表シスピニレン基又はフェニレン基を示し、Zはエチレン、スピニレン基、OCH·又はS(O)。CH·を示し、R'シクロアルキル基、Ci-nのアルキル基で置換されたCi-ルキル基、Ci-nのアルキルを又は多のアルキニルを又 炭化水素基を示し、R'は水素原子、Ci-nのアルキル基 のシクロアルキル基を示し、R'は水素原子、Ci-nのアルキル基 のシクロアルキル基を示し、mは1~3の整数を示し、又は2を示す。)

で表されるプロスタグランジン誘導体又はその薬理学的る塩および水和物を有効成分とする睡眠誘発剤。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使

人ピーアラブ音楽画運転

入し、テルルニア AM アルメニア

A() オーフェリア A() オーフェリア a() オーストラリア DM ドミニカ EE エストエア ES グペイン

デエーフィンランド FR フランス | K2||カザフスタン| | LC|| セントルシア

1.1 リモデンシュダイン 1.K メリ・ランカ

(57)要約

式

2012

6

表 1

	<u> </u>	<u> </u>	<u></u>	R '	R_2
化合物 1	B -01	CH = CH	0 CH 2	シケロヘキシル	tert-7' f#
化合物 2	0 -01	CH = CH	0 C H 2	シクロヘキシル	84 N
化合物3	8 -(1	CB-0H	0.CH2	シクロヘキシル	A.F.III
化合物性	B - C	CH = CH	OCHE	シクロペキシル	水素
化合物 5	B - C1	CH = CH	0 CH 2	シクロペキシル	水素
化合物 č	a -(')	CHECH	0 C H z	シクロヘキシが	水素
化合物?	B -Br	(H = CH)	0 C H 2	シクロペキシル	水素
化台物区	B -B:	CH = CH	$0.0E_{\rm P}$	シクロペキシル	水素
化合物品	);	TH = CH	0.0115	沙グロベキシル	水素
化合物 10	8 Br	€ H = € H	OCH2	シケロペーンチが	水素
化台物门	8 -81	€ H = CH	HPH2	ንታ <b>ኮ</b> ላን" ቶቱ	水彩
化合物12	B - B1	(	OCR.	シクロヘミンチルメチル	水素
化台物13	β −Br	( )	$0.0\mathrm{H}_{\mathrm{F}}$	シクロヘキシルメチル	水素
化合物口	(f - ( )	CH = UH	SCH	シケロヘキシル	tert-2° f#
化合物 15	p - 01	CH = CH	SCH2	ን <b>ታ</b> ዕላ <b>부</b> シ»	水素
化合物16	8 -01	CHECHE	00162	シクロハキシル	tert-7 fb

WO 99/61029

PC

3/20/00 5:00 PM

#### **PCT**

#### 世界知的所有縱機開 国際事務局

#### 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6 A61K 31/557, C07C 405/00

A1

(11) 国際公開番号

(43) 国際公開日

Ţijŧ

(21) 国際田嬢番号

PCT/JP99/02723

(22) 国際出願日

1999年5月25日(25,05,99)。

(30) 優先権データ

精額平10/142622

1998年5月25日(25.05.98)

(71) 田願人 (米国を貯ぐすべての指定匿について)

火正製薬床式会社

(TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)[JP/JP]

〒170-8633 東京都豊島医高田3丁目24番1号 Tokyo, (P)

- (71) 出願人;および
- (72) 范明者

住職更商GATO, Fumic)[JP/JP]

〒251-0026 神奈川県藤沢市鴨滘東2-1-901 Kanagawa, (JP)

172) 発明者:および

(75) 発明者/問頗人(米国についての

用名見亨(TANAMI, Tolum)[JP/JP] 龟尾一郭(KAMEO, Kazuya)[JP/JP]

山田港司(YAMADA, Kenji)[JP/JP]

奥山 茂(OKUYAMA, Shigeru)[JP/JP]

小野直哉(ONO, Naova)[JP/JP]

〒170-8633 東京都農島區高田3丁目24號

大正製薬株式会社内 Tokyo、(JP)

(74) 代理人

奔理士 北川富造(KITAGAWA, Tomize 〒170-8633 東京都豐島区高田3丁目247 大正製集株式会社: 特許部 Tokyo.(JP)

(81) 指定国 AU, CA, CN, JP, KR, Ut CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, 10.

添付公開書類

雷台雅查點類國

SLEEP INDUCING AGENT (54) Title:

(54)発明四名部。 

#### (57) Abstract

A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>, a visvinylone group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinytone group, OCH2 or SiOh,CH2, R1 is a Com cycloalkyl group, a Com eyeloalkyl group substituted with a Una alkyl group, a Care pycloalkyfalkyl group, a Cam alkyl group, a Cam

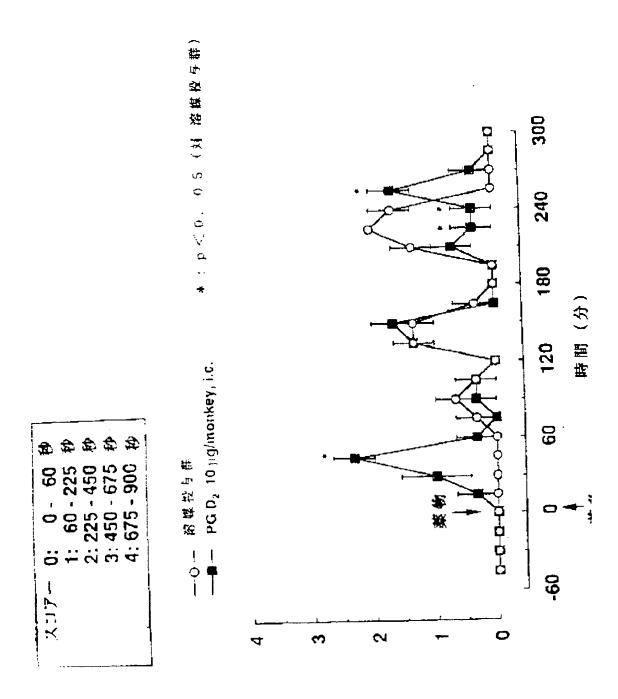
0 - 50 BA 60 - 225 BA SCORE 2: 225 - 450 MA 3: 450 - 675 BA 4: 675 - 800 gA

P ----- \*\* G # # # #

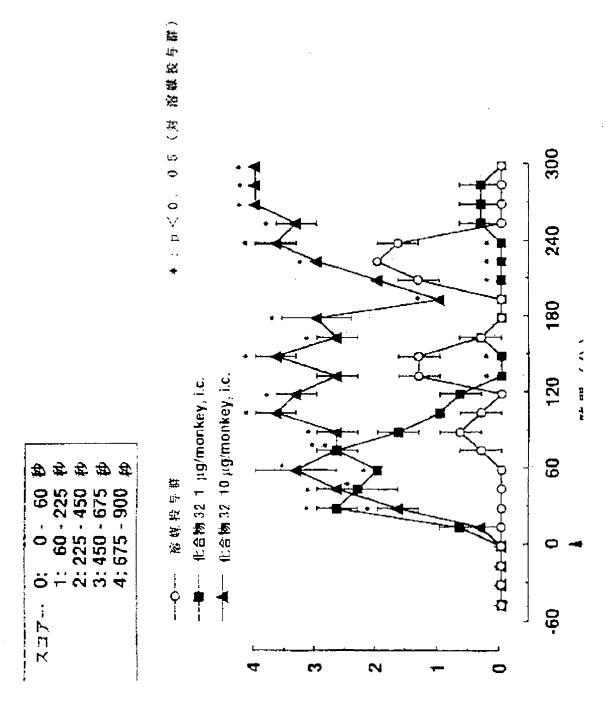
C --- C合物 20 1 ppymonusy, i.e. □ 一部一 作品物 32 10 µg-monkey, Lc.

• : p ≤ 0.









9

表上のつづき

	X			R i	$\mathbb{R}^{-2}$
化合物 21	<i>β</i> +01	CH a CH .	CH + CH	500 A + 2∥	水素
化合物72	β =C1	снусизску	() H = () H	940AF9#	水素
化合物73	<i>i</i> 3 −€1	CHeCHe	CM = CH	ን <b>ታ</b> ወለ* ንቶዜ	33%
化合物74	8 -01	СИзСНэ	CH = CH	\$4 <b>0</b> ~~ >44	水素
化合物75	β -0]	CH : CH :	CH = CH	59 <b>□</b> ヘ2 <sup>1</sup> β⊮	6 F N
化合物和	f! +(`)	$\mathbb{C}H\oplus\mathbb{C}H+$	CH = CH	<i>ን∄</i> ⊡ላጋ"ቸው	水業
化分割剂77	13 - U.I	CH : CH -	() H = () H	タケロベーンチ族メチル	大手を
化合物78	ß C1	CII 2 CH 2	€ H = € H	<u>አ</u> ለመለ <sup>ተ</sup> ጋቶ康ያቶቱ	水素
在台灣和	8-01	UHrCHr	€.H = € N	シクロペキシガメナル	1. f. j.
化合物80	B = 0	CHICHI	CH = ( H	p#PA#\$####	水素
化合物制	8-01	CHaCNa	£]{={]]]	2ーメチル キーヘキッド	% <b>4</b> %
化合物 80	$\hat{\mu}^{(i)}_{i} = \{[i]_i\}$	CH+CH+	CH = CH	2-194-1-0496	水素
化合物 (3	<i>(f</i> = € )	CH 2 CH 2	CH = CH	2, 6-2 / ////-5-57 72%	15W
化合物料	pr = 0]	CH -CH;	CH-CH	2 6 (多) 大手が一ちゃんで、多点が	水本
准占物制	g <sup>6</sup> - 0.1	CH 2 CH 2	€ H = € H	$1 = k \oplus k + (k + \gamma + \gamma + \beta + 1)k$	i f n
化台物 86	P = ( 1	OH CH.	(H=(H)	1 - 7 7 4 - 3   2 4 3 2 4 3	水灌

本発明に係る化合物は、経口的に、または静脈内もしく 与などの非経口的に投与することができる。これらは、例 常の方法により製造することができる錠剤、粉剤、顆粒剤 カプセル剤、液剤、乳剤、整濁剤等の形で経口投与するこ

WO 99/61029

9

## 表上のつづき

-	<u> </u>	<u>- Y</u>	Ζ	R :	<u> </u>
化合物 71	$\beta > 01$	CH = CH =	$\mathbb{C}\mathbf{H}=\mathbf{C}\mathbf{H}$	シケロへキシル	水素
化合物 72	£ −C1	CH 2 CH 2 CH 2	CH = CH	シケロヘキシル	水 素

 $\mathbf{PC}$ 

8

• •	<u> </u>	Y	<u> </u>	<u>R</u> 3	R <sup>y</sup>
化合物45	8 -01	CH 2 CH 2	SCH2	2,8-91354-5-477724	水素
化合物46	$\beta = 0$	0=(29-2111)	0 CH 2	シタロヘキシル	水素
化合物47	p) =01	m・インターフェニルン	0 <b>C</b> H 2	<u> </u>	水赤
化合物48	β -01	p (10% 7±100)	00H2	シクロヘキシル	水素
化合物49	$\beta = 0$	0-(29-7221)	SCH	シタロヘキンル	水素
化合物 80	B -( )	mーイング・フェニトン	SCH	シクロへもシボ	水素
化合物 \$1	$\beta > C1$	$p=\{(>\emptyset): 7: 1\subseteq \emptyset\}$	$S\mathbb{C}H _{\mathcal{Z}}$	9 <b>≬⊓</b> ∧≉9₿	水素
化合物粉	3-01	CH + CH +	CH o CH 2	シタロヘキシル	大手 II
化合物 83	月 -(1	CH / CH ·	CHaCut	シタロへもシル	水囊
化台物54	$\beta = 0$	CH+	CHICHE	<b>分差四</b> 人中分址	水素
化合物部	$p(t) = \{t^*\}$	CH+CH-	CHaCRa	シクロヘーンチル	水素
化合物 56	β -C1	CHOCHO	CH & CH +	ኃ <b>ንበ</b> ላን" ቶሎ	水素
化合物 57	β -01	$(H_{\mathcal{F}}) H_{\mathcal{F}}$	CH + CH 2	シクロヘニンチルメチル	አቶ <i>ቤ</i>
化台物(8	B -(1	CH - CH -	CH.CH.	シク狂へ゛ンチルメチル	水素
化合物的	p = (1	OH-CH.	CH2 (H)	シクロベキシルメチル	亲手排
化合物间	8-01	$\{(H \cup C)\}\}$	CHBECH-	シケロペキンドメデル	水素
化合物句	ë €!	CHICH	(H) (H)	2	\$ <b>+</b> \$
化合物CD	8 -(1	CH + CH;	CH a CH >	$2=\lambda + \mu + \psi + \gamma + \gamma + \psi + \mu$	水素
化合物码	B -11	$CH \ni CH +$	CH = CH =	$2\cdot (6-3)^{*} \mathcal{MF} \hat{y} - 5 + \langle \gamma^{*}   \tilde{\gamma} \subseteq \hat{y} \rangle$	*##
化台物64	A-tl	CHECH	(H): CH2	2. 6-9° 8+6-5-07° +=N	水素
化台物 65	8-()	€# - €# -	CH+(H)	1 - 差手地 - 3 - 八年少二度	x # 14
化台物 66	6-11	CH / CB +	(HeCH)	チェメチル・3 - ベキシニル	水素

WO 99/61029

NAME OF THE PROPERTY OF THE PARTY OF THE PAR

8

• •	X	Y	<u>Z</u>	<u> </u>	R Y
化合物45	8-01	UII » CH »	SCH 2	2, 6-91 /##-5-57 90#	水素
化合物46	3 =01 c	ーインターフェニレン	0 CH 2	シケロヘキシル	水素

mar on a national

ï

may a sure production of market and market and the

14.4	Χ	<u>Y</u>		R	$\mathbb{R}^{-2}$
化音物19	8-01	CH v CH 2	0 C <b>H</b> 2	シケロペキシル	水素
化合物20	B =01	CH 5 CH 2	{) ( }	シクロペキシル	水素。
化合物引	8 -01	CH a CH a	0 CH 2	シクロヘーンチが	水素
化合物22	$\beta$ =01	CH a CH o	0 CH 2	9 <b>∂α</b> Λ7 <sup>°</sup> ₹#	水素
化合物23	β -C1	CH = CH =	0 CH :	シクロペーンチルメチが	水素
化台物24	B -01	$CH \not = CH \not =$	0 CH 2	シクロヘキシルメチル	水素
化合物35	a-Ct	$CH \ge CH \ge$	0 CH z	シタロヘキシル	水素
化音物 26	S-Br	CH w CH z	0 CH :	シクロペキタル	水素
化台物27	a -B1	СНубие	0 C H ×	シクロペキシル	水素
化合物 28	F	СНаСНа	$0.0\mathrm{H}_{2}$	<u></u> シクロヘキシル	水素
化合物器	j6 - U j	CHACHI	SCH a	99 <b>□</b> △#9⊅	ter(~7° £W
化合物 30	B -C1	CH a CH +	SCHO	シクロヘキシル	} <b>#</b> #
化台物制	8 -01	$CH \sim C  I /2$	SCH2	<b>沙女日本</b> 牛乡ル	k F Ar
化台物32	8-01	CH+CH	SCH	<u></u> የዕወላ‡ንዙ	水素
<b>化合物</b> 33	B -01	FHECHE	SCHE	2 <b>9日本</b> 年多數	水 素
化含物34	B C1	(H-CH-	SCH.	今夏日本本文庫	水素
七台物35	<i>B</i> =01	CHICH:	NCH a	ቅላወላ <sup>*</sup> ጋታው	水素
化合物 316	$\beta = 01$	CH+CH)	SCRa	シクロベニンチルメチル	水素
化台物37	β -C1	CH : CH :	$S(C(H)_{\mathcal{R}})$	シクロヘギシをメチル	水素
化合物 88	$\alpha = 0.1$	CH ± CH +	SCH:	シクロヘキシル	水 義
化合物39	β −Вг	CH+CH2	SCH-	ジタロペネジル	水素
化合物40	ce =Br	$C(H) + C(H)_{\mathcal{T}}$	S C H 🕫	シタロペキシル	水素

WO 99/61029

7

14 <del>days</del>	Χ	Y	<u>Z</u>	R_'	R <sup>-2</sup>
化合物19	8 -01	CH & CH :	0 CH 2	シケロペキシル	水素
化合物20	β = 01	CH ≈ CH :	0 CH 2	シケロヘキシル	水 素